

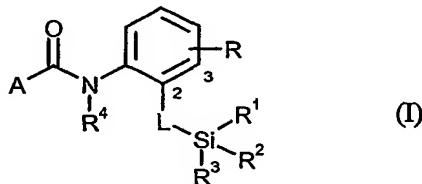
Silylierte Carboxamide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue silylierte Carboxamide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 03/080628, WO 03/010149, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

10 Es wurden nun neue silylierte Carboxamide der Formel (I)



gefunden, in welcher

R für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L für eine direkte Bindung oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes geradkettiges oder
15 verzweigtes Alkylen (Alkandiyl), Alkenylen (Alkendiyl) oder Alkinylen (Alkindiyl) steht,

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl stehen,

R³ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-
20 Halogenalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl steht,

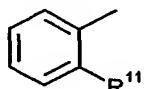
R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl-sulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht,

- 2 -

- R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R⁶ und R⁷ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,
- R⁸ und R⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R⁸ und R⁹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,
- R¹⁰ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

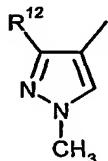
A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,
oder

A für den Rest der Formel (A2)



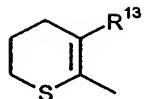
(A2) steht, in welcher

R¹² für Chlor, Iod oder Dichlormethyl steht,

oder

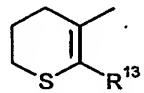
A für den Rest der Formel (A3)

- 3 -



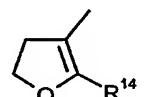
(A3) steht, in welcher

- 20 R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,
oder
A für den Rest der Formel (A4)



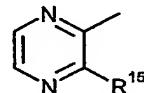
(A4) steht, in welcher

- 5 R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,
oder
A für den Rest der Formel (A5)



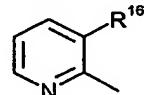
(A5) steht, in welcher

- 10 R¹⁴ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,
oder
A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

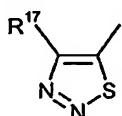
- 15 R¹⁵ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogen-
atomen steht,
oder
A für den Rest der Formel (A7)



(A7) steht, in welcher

- 20 R¹⁶ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-
Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5
Halogenatomen steht,

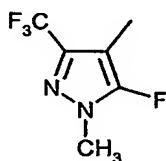
- oder
A für den Rest der Formel (A8)



(A8) steht, in welcher

- 25 R¹⁷ für C₁-C₄-Alkyl steht,
oder

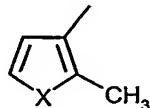
A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



(A10) steht, in welcher

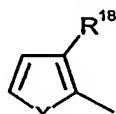
5

in welcher

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

10

in welcher

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

R¹⁸ für Iod oder Methyl steht.

15 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen beansprucht.

20

Weiterhin wurde gefunden, dass man silylierte Carboxamide der Formel (I) erhält, indem man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

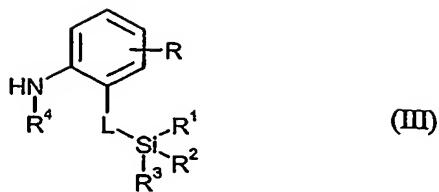


in welcher

25 X¹ für Halogen oder Hydroxy steht und

A die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Aminen der Formel (III)

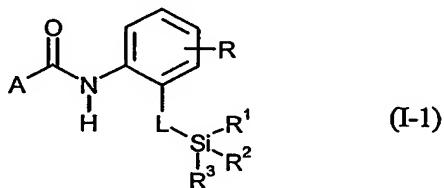


in welcher R, L, R¹, R², R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Konden-
sationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

5

oder

- b) silylierte Carboxamide der Formel (I-1)



in welcher R, L, R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Halogeniden der Formel (VIII)

10



in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

15

R^{4a} für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht, wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

25

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen silylierten Carboxamide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

5 Die erfindungsgemäßen silylierten Carboxamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restedefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

- 10 R steht bevorzugt für Wasserstoff.
 R steht außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 4-, 5- oder 6-Position, ganz besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position, insbesondere in 4-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 R steht außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 5-Position des
 15 Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 R steht außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 R steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4- oder 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 20 L steht bevorzugt für eine direkte Bindung oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkenylen oder C₂-C₆-Alkinylen.
 L steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung oder für -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-,
 25 -CH(Me)-, -CH(Me)CH₂-, -CH₂CH(Me)-, -CH(Me)CH(Me)-, -C(Me₂)CH₂-,
 -CH(Me)-(CH₂)₂-, -CH(Me)-(CH₂)₃-, -CH=CH-, -C(Me)=CH- oder -C≡C-.
 L steht ganz besonders bevorzugt für -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -CH(Me)-, -CH(Me)CH₂-,
 30 -CH(Me)-(CH₂)₂-, -CH(Me)-(CH₂)₃-, -CH=CH-, -C(Me)=CH- oder -C≡C-.

R¹ und R² stehen unabhängig voneinander bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl oder C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl.

R¹ und R² stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl oder Ethylthioethyl.

R¹ und R² stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxy, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.

R¹ und R² stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Methyl.

- R³ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl.
- R³ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, sec-, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, n-, sec-, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl, Ethylthioethyl, Cyclopropyl, Phenyl oder Benzyl.
- R³ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl, Methylthiomethyl oder Phenyl.
- 10 R³ steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy.
- R³ steht hervorgehoben für Methyl.
- R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹.
- R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH(CH₃)₂, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃,

$-(\text{CH}_2)_2\text{CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$;

5 Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,
 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ oder $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$.

10 R^4 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl,
 $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH(CH}_3)_2$,
 $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$.

15 R^4 steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.

20 R^5 steht bevorzugt für Wasserstoff, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_3\text{-alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkyl}$; $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkoxy}$, Halogen- $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-alkoxy-C}_1\text{-C}_3\text{-alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Halogenycloalkyl}$ mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

25 R^5 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Methoxymethyl, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy.

30 R^6 und R^7 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-Alkoxy-C}_1\text{-C}_3\text{-alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkyl}$; $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}$, Halogen- $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-alkoxy-C}_1\text{-C}_3\text{-alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Halogenycloalkyl}$ mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

35 R^6 und R^7 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{10} enthalten kann.

40 R^6 und R^7 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluoreethyl, Trifluormethoxymethyl.

45 R^6 und R^7 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morphinol, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^{10} substituiert sein kann.

R⁸ und R⁹ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R⁸ und R⁹ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt 5 einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann.

R⁸ und R⁹ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- 10 oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluoreethyl, Trifluormethoxymethyl.

R⁸ und R⁹ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt 15 einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morphinol, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R¹⁰ substituiert sein kann.

R¹⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

R¹⁰ steht besonders bevorzugt 20 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

A steht bevorzugt für einen der oben angegebenen Reste A1, A2, A5 oder A7.

A steht außerdem bevorzugt für A6, A10 oder A11.

A steht besonders bevorzugt 25 für den Rest A1.

A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A2.

A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A5.

A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A6.

A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A7.

A steht außerdem besonders bevorzugt 30 für den Rest A10.

A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A11.

R¹¹ steht bevorzugt 35 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

- 5 R¹¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlor-methoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio.
- 10 R¹¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- 15 R¹¹ steht insbesondere bevorzugt für Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.
- 10 R¹² steht bevorzugt für Iod.
- 15 R¹² steht außerdem bevorzugt für Chlor.
- 20 R¹² steht außerdem bevorzugt für Dichlormethyl.
- 15 R¹³ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 20 R¹³ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlor-methyl oder Trichlormethyl.
- 25 R¹³ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlor-methyl.
- 15 R¹⁴ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 20 R¹⁴ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlor-methyl oder Trichlormethyl.
- 25 R¹⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlor-methyl.
- 30 R¹⁴ steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Trifluormethyl.
- 30 R¹⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 35 R¹⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
- 30 R¹⁶ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R¹⁶ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Disluorchlormethyl, Trichlormethyl.

5 R¹⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R¹⁷ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.

R¹⁷ steht besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl.

10 X steht bevorzugt für O (Sauerstoff).

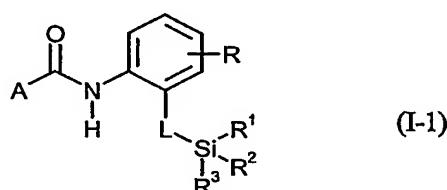
X steht außerdem bevorzugt für S (Schwefel).

R¹⁸ steht bevorzugt für Iod.

R¹⁸ steht außerdem bevorzugt für Methyl.

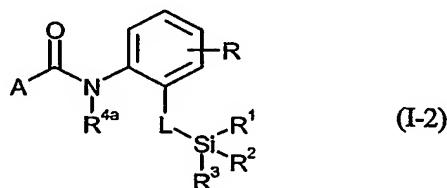
15

Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-1)



in welcher R, L, R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

20 Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-2)



in welcher R, L, R¹, R², R³, R^{4a} und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

R^{4a} steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-

25 C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogen-

alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halo-

gencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-

C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-

- 12 -

(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl,

5 (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹, wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10 R^{4a} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl,

Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃,

15 -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃,

-(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂, -CH₂-CO₂CH₃, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂,

-(CH₂)₂-CO₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂, -CH₂-CO-CF₃,

-CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃,

-(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CH₂CF₃, -CH₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃,

20 -(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CF₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃,

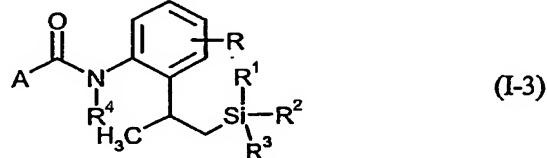
-(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃;

Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹,

25 wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

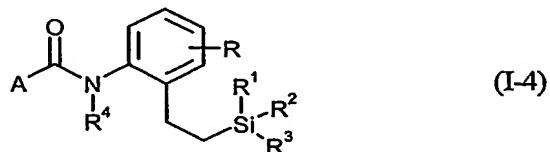
R^{4a} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₂CH₃.

30 Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-3)



in welcher R, R¹, R², R³, R⁴ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-4)



in welcher R, R¹, R², R³, R⁴ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

- 5 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

10

Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

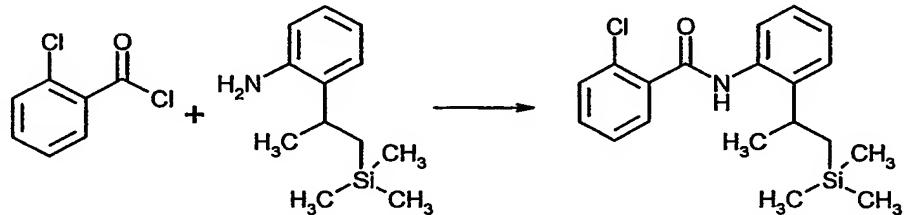
- 15 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

Erläuterungen der Verfahren und Zwischenprodukte

20

Verfahren (a)

- Verwendet man beispielsweise 2-Chlorbenzoylchlorid und {2-[1-Methyl-2-(trimethylsilyl)ethyl]phenyl}amin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits

im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X¹ steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

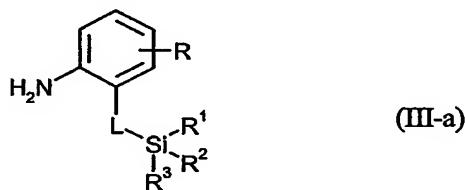
5 Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bekannt und/oder können nach bekannten Methoden erhalten werden (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 und DE-A 103 25 439.0).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten 10 Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R, L, R¹, R², R³ und R⁴ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

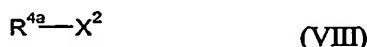
15

Die Amine der Formel (III) sind bekannt und/oder können auf bekannte Weise erhalten werden (vgl. WO 03/080628 und die Herstellungsbeispiele).

Amine der Formel (III), in welcher R⁴ nicht für Wasserstoff steht, können beispielsweise erhalten 20 werden, indem man Amine der Formel (III-a)



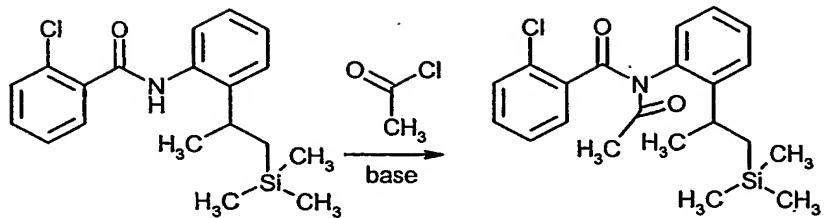
in welcher R, L, R¹, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Halogeniden der Formel (VIII)



25 in welcher X² und R^{4a} die oben angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt [die Reaktionsbedingungen des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) gelten entsprechend].

Verfahren (b)

30 Verwendet man 2-Chlor-N-{2-[1-methyl-2-(trimethylsilyl)ethyl]phenyl}benzamid und Acetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten silylierten Carboxamide sind durch die Formel (I-1) allgemein definiert. In dieser Formel (I-1) haben R, L, R¹, R², R³, R⁴ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Verbindungen der Formel (I-1) sind erfindungsgemäße Verbindungen und können nach dem Verfahren (a) hergestellt werden.

Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen alle internen organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen alle internen organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säure-akzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithiumdiisopropylamid, Natriummethylat, Natriumethylat, Kalium-tert-butylat, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) wird in Gegenwart einer geeigneten Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithiumdiisopropylamid, Natriummethylat, Natriumethylat, Kalium-tert-butylat, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat; sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethyl-ester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidino-phosphonium-hexafluorophosphat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 120°C, besonders bevorzugt bei Temperaturen von 10°C bis 80°C.

5

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

- 10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Amin der Formel (III) und 1 bis 3 Mol eines Säurebindermittels ein.
- 15 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man pro Mol an silyliertem Carbox-amid der Formel (I-1) im Allgemeinen 0.2 bis 5 Mol, bevorzugt 0.5 bis 2 Mol eines Halogenids der Formel (VIII) ein.

- 20 Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

- 25 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

- 30 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 35 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae; Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

- Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
- Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
- Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
- Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder
- 5 Pseudoperonospora cubensis;
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
- Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
- Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- 10 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
- Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
(Konidienform: Drechslera, Syn: *Helminthosporium*);
- 15 Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: Drechslera, Syn: *Helminthosporium*);
- Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
- 20 Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
- Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
- Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
- Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
- 25 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
- Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
- Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
- Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
- Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
- 30 Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercosporella herpotrichoides*,
- Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte

35 Mikroorganismen.

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

5

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich 10 im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- 15 und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, 20 einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

30 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle 35

oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,

Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,

- Coniophora, wie *Coniophora puetana*,
Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,
Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,
Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
5 Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,
Escherichia, wie *Escherichia coli*,
Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,
10 Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren 15 Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmmebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/ oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also 20 Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol- 25 Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen 30 infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate 35 aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als

Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

25

Fungizide:

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyll; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofuanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole;

Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyd; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclo; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris-albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyd; Metalaxyd-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclbutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propano-sine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenoxy; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorophenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]-ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natrium-tetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

Bakterizide:

30 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

35 Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-

Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflurnet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin, Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacyl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathifos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbophuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlova-porthrin, Chromafenozone, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clopythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazaben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Emamectin, Emamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimes, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropothrin, Fenpyrad, Fenpyriprithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Fluopyrazofos, Flutenzin (Flufenazine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozone, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, Kempolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-

9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthroate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb,

5 Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Pro-petamphos, Propoxur, Prothifos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulpro-
10 fos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozone, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Tri-
15 azophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluoro-ethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-
20 endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

25 Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphatische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie *Candida albicans*, *Candida glabrata*) sowie *Epidermophyton floccosum*,
30 *Aspergillus*-Spezies wie *Aspergillus niger* und *Aspergillus fumigatus*, *Trichophyton*-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, *Microsporon*-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

35 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche

Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch
5 das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und
10 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

15 Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden
20 transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

25 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

30 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der
35 erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen

Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

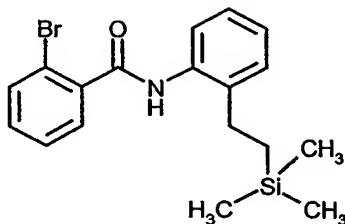
5

Zu den bevorzugten erfundungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, 10 erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen 15 gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, 20 Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den 25 Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systernin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirk- 30 stoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben 35 werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und

Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien 5 auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der 10 allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

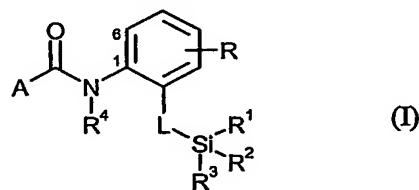
15 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

5 425 mg 2-(2-Trimethylsilyl-ethyl)-phenylamin (2.2 mmol) und 438 mg (2.0 mmol) 2-Brombenzoylchlorid wurden in 20 ml Acetonitril gelöst und 332 mg (2.4 mmol) Kaliumcarbonat zugegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 18 h bei Raumtemperatur gerührt, dann 20 ml Wasser zugegeben und mit Essigsäureethylester extrahiert und über Natriumsulfat getrocknet. Nach Entfernung des Lösungsmittels und säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 (Laufmittel: Methylenchlorid)

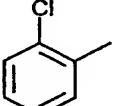
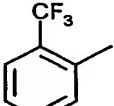
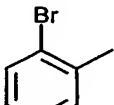
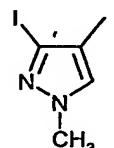
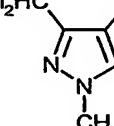
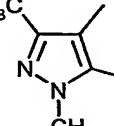
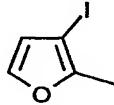
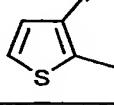
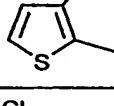
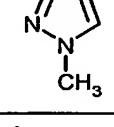
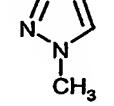
10 10 wurden 405 mg (54 % der Theorie) an 2-Brom-N-[2-(2-trimethylsilyl-ethyl)-phenyl]-benzamid erhalten [LogP (pH 2.3) = 4.32].

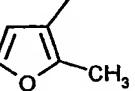
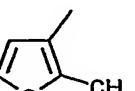
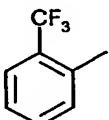
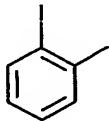
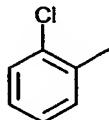
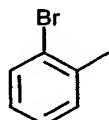
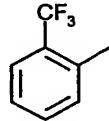
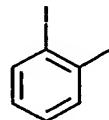
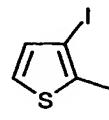
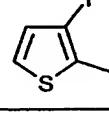
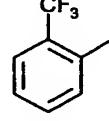
Analog Beispiel 1 sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellverfahren (a) und (b) wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten
15 Verbindungen der Formel (I) erhalten:

Tabelle 1

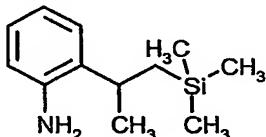
Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
2	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.67
3	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.63
4	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.40

- 30 -

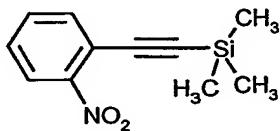
Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
5	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.29
6	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.37
7	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.58
8	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.68
9	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.95
10	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.19
11	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.73
12	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		5.05
13	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.43
14	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.89
15	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.94

Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
16	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.03
17	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.33
18	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.78
19	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.97
20	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.96
21	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.93
22	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.61
23	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.64
24	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.85
25	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.79
26	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.39

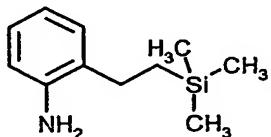
Die mit Stern (*) markierte Bindung ist mit dem den Anilinrest verknüpft, die mit Raute (#) markierte Bindung mit dem Silicium-Substituenten verbunden.

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (III)Beispiel (III-1)

5 17.7 g Anilin (0.19 mol), 50 g Allyltrimethylsilan (0.44 mol), 1.5 g Aluminiumtrichlorid (0.01 mol) und 0.5 g Aluminiumpulver (0.02 mol) wurden gemischt und im Autoklaven für 10 h bei 255°C gerührt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wurden zuerst 100 ml Toluol, dann 40 ml einer 40%igen NaOH-Lösung in Wasser und 100 ml Wasser zugegeben und 15 min bei 35°C gerührt. Nach dem Abkühlen wurde mit Toluol extrahiert, mit Wasser gewaschen, über Kaliumcarbonat 10 getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Nach Destillation (55°C-60°C, 0.08 mbar) erhielt man 1.4 g 2-(1-Methyl-2-trimethylsilyl-ethyl)-phenylamin [LogP (pH 2.3) = 3.05].

Beispiel (III-2)*Stufe 1*

15 4 g (20 mmol) ortho-Bromnitrobenzol, 842 mg (1.2 mmol) Bis(triphenylphosphin)palladium(II)chlorid und 230 mg (1.2 mmol) Kupfer(I)iodid wurden in 40 ml Triethylamin unter Argon vorgelegt. Anschließend wurde bei Raumtemperatur innerhalb von 10 min 2.95 g (30 mmol) Trimethylsilylacetylen zugetropft und 2 Tage bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde auf 50 ml Wasser gegossen, 3 mal mit je 50 ml Diethylether extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft. Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 (Laufmittel: Cyclohexan/Ethylacetat 20 3:1) wurden 4.2 g (96 % der Theorie) an Trimethyl-(2-nitro-phenylethynyl)-silan erhalten [LogP (pH 2.3) = 4.12].

25 Stufe 2

10.9 g (50 mmol) Trimethyl-(2-nitro-phenylethynyl)-silan wurden in 200 ml Methanol gelöst und 0.5 g Palladium-Kohle (5 %) zugegeben. Anschließend wurde im Autoklaven 12 h bei 4 bar hydriert. Nach Entfernung des Lösungsmittels und säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60

- 33 -

(Laufmittel: Methylenchlorid) wurden 4.1 g an 2-(2-Trimethylsilyl-ethyl)-phenylamin erhalten [LogP (pH 2.3) = 2.58].

- 5 Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.
Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich (pH 2,3): 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.
- 10 Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren LogP-Werte bekannt sind (Bestimmung der LogP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).
Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

AnwendungsbeispieleBeispiel A

5 Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inkuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20 Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

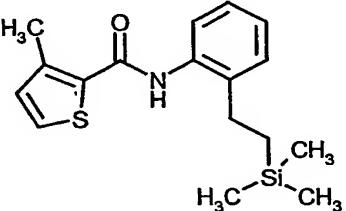
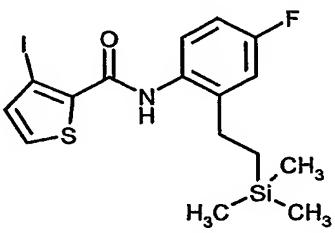
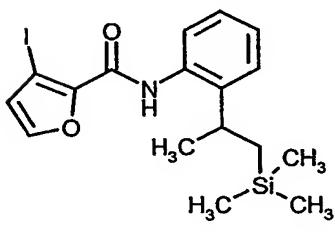
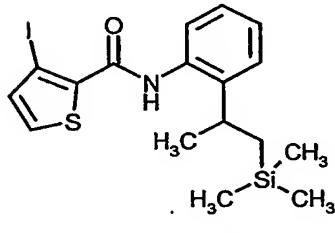
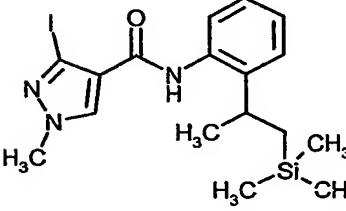
25 10 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle A

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	99
	100	100
	100	84
	100	87
	100	100
	100	100

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	99

Beispiel B**Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

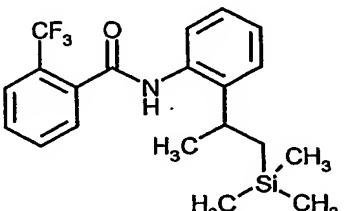
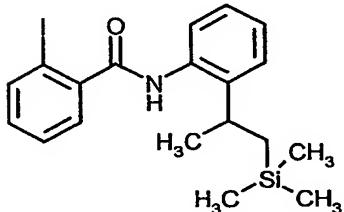
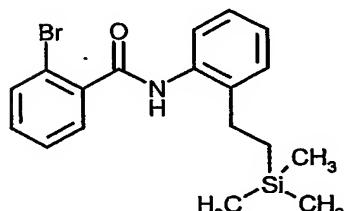
5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
10 auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von Sphaerotheca fuliginea inkuliert. Anschließend werden die
15 Pflanzen in einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

7 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein
20 Befall beobachtet wird.

Tabelle B**Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	750	100
	750	100
	750	100

Beispiel C**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

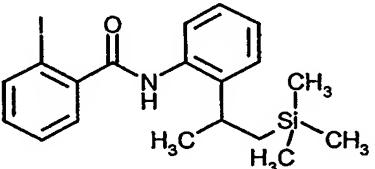
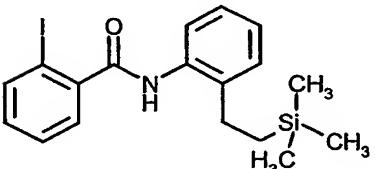
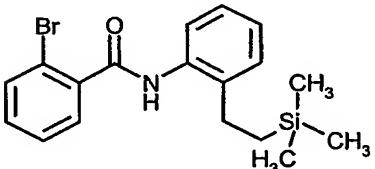
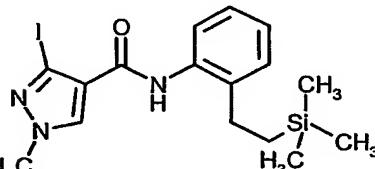
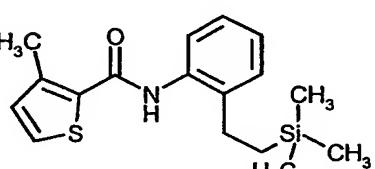
5 Lösungsmittel: 50 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
10 auf die gewünschte Konzentration.

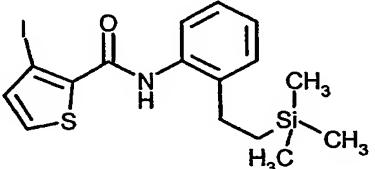
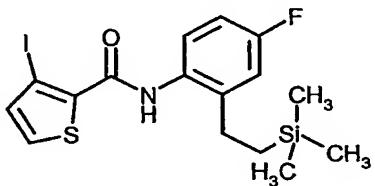
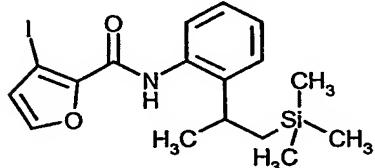
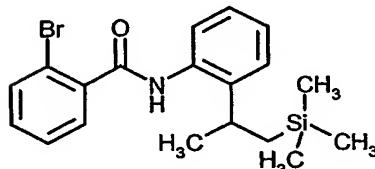
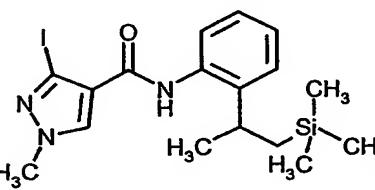
Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei
15 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.
20 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle C**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

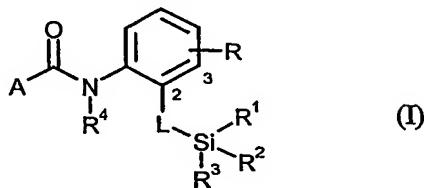
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	93
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff Erfundungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Patentansprüche

1. Silylierte Carboxamide der Formel (I)



5 in welcher

R für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L für eine direkte Bindung oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes geradkettiges oder verzweigtes Alkylen (Alkandiyl), Alkenylen (Alkendiyl) oder Alkinylen (Alkin-diyl) steht,

10 R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl stehen,

15 R³ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkyl-thio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halo-15 genalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl steht,

20 R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

25 (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbo-nyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalk-oxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencyclo-alkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht,

30 R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

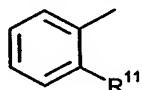
5 R⁶ und R⁷ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,

10 R⁸ und R⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

15 R⁸ und R⁹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,

R¹⁰ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

20 A für den Rest der Formel (A1)

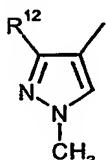


(A1) steht, in welcher

R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

25 oder

A für den Rest der Formel (A2)

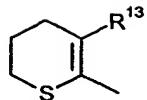


(A2) steht, in welcher

R¹² für Chlor, Iod oder Dichlormethyl steht,

oder

30 A für den Rest der Formel (A3)

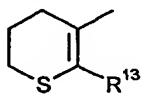


(A3) steht, in welcher

R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)



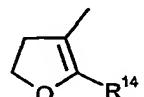
(A4) steht, in welcher

5

R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



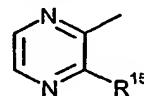
(A5) steht, in welcher

10

R¹⁴ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



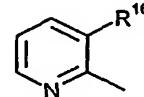
(A6) steht, in welcher

15

R¹⁵ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)



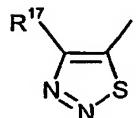
(A7) steht, in welcher

20

R¹⁶ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)



(A8) steht, in welcher

25

R¹⁷ für C₁-C₄-Alkyl steht,

oder

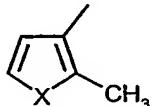
A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



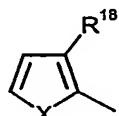
(A10) steht, in welcher

5

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

10

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

R¹⁸ für Iod oder Methyl steht.

2. Silylierte Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

15

L für eine direkte Bindung oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkenylen oder C₂-C₆-Alkinylen steht,

R¹ und R² unabhängig voneinander für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl oder C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl stehen,

20

R³ für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

25

C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

- 46 -

(C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder

5 -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht,

R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

10 R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

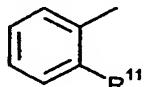
15 R⁶ und R⁷ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,

20 R⁸ und R⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

25 R⁸ und R⁹ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,

R¹⁰ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

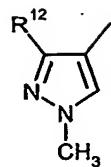
30

R¹¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

35

A für den Rest der Formel (A2)

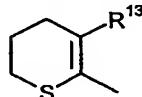


(A2) steht, in welcher

R¹² für Chlor, Iod oder Dichlormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



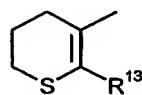
(A3) steht, in welcher

5

R¹³ für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)



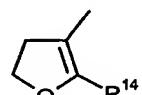
(A4) steht, in welcher

10

R¹³ für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



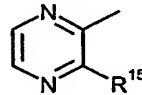
(A5) steht, in welcher

15

R¹⁴ für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



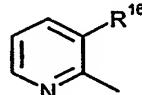
(A6) steht, in welcher

20

R¹⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)



(A7) steht, in welcher

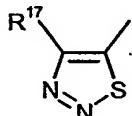
25

- 48 -

16 R^{16} für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A8)

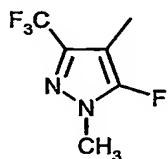


(A8) steht, in welcher

R¹⁷ für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl steht,

oder

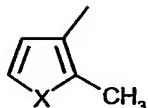
10 A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)

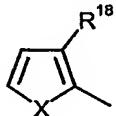


(A10) steht, in welcher

15 X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



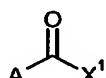
(A11) steht, in welcher

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

20 R¹⁸ für Iod oder Methyl steht.

3. Verfahren zum Herstellen von silylierten Carboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

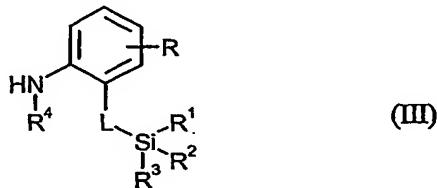


(II)

25

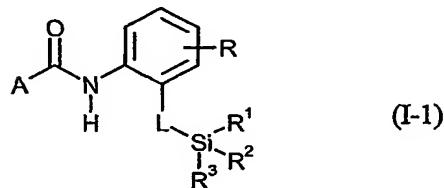
in welcher

- X¹ für Halogen oder Hydroxy steht und
 A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,
 mit Aminen der Formel (III)



5 in welcher R, L, R¹, R², R³ und R⁴ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

10 oder
 b) silylierte Carboxamide der Formel (I-1)



in welcher R, L, R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
 mit Halogeniden der Formel (VIII)



in welcher
 X² für Chlor, Brom oder Iod steht,
 R^{4a} für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbo-

- 50 -

nyl, (C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ oder $-CH_2NR^8R^9$ steht, wobei R^5 , R^6 , R^7 , R^8 und R^9 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5 in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

4. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem silylierten Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 10 5. Verwendung von silylierten Carboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.
- 15 6. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man silylierten Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum aus bringt.
- 20 7. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man silylierten Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07F7/08

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07F

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; COSTA, MIRCO ET AL: "Synthesis of 4H-3,1-Benzoxazines, Quinazolin-2-ones, and Quinolin-4-ones by Palladium-Catalyzed Oxidative Carbonylation of 2-Ethynylaniline Derivatives" XP002315416 retrieved from STN Database accession no. 2004:189014 abstract & JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY , 69(7), 2469-2477 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 2004,</p> <p>-----</p> <p style="text-align: center;">-/-</p>	1, 2

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the International filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 January 2005

Date of mailing of the international search report

18/02/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax. (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Richter, H

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/012590

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BARTOLI, GIUSEPPE ET AL: "A new approach to the synthesis of 2-substituted indoles: reaction of dimetallated ortho-trimethylsilylmethylanilides with esters" XP002315417 retrieved from STN Database accession no. 1990:423608 abstract & TETRAHEDRON , 46(4), 1379-84 CODEN: TETRAB; ISSN: 0040-4020, 1990, -----</p>	1,2
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SAKAMOTO, TAKAO ET AL: "Condensed heteroaromatic ring systems. XII. Synthesis of indole derivatives from ethyl 2-bromocarbanilates" XP002315418 retrieved from STN Database accession no. 1988:75166 abstract & CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN , 35(5), 1823-8 CODEN: CPBTAL; ISSN: 0009-2363, 1987, -----</p>	1,2
X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HELLWINKEL, DIETER ET AL: "Carbanionically induced '1,3!-migrations of .pi.- and coordinatively unsaturated groups" XP002315419 retrieved from STN Database accession no. 1984:5549 abstract & CHEMISCHE BERICHTE , 116(10), 3375-405 CODEN: CHBEAM; ISSN: 0009-2940, 1983, -----</p>	1,2
Y	<p>EP 0 538 231 A (MONSANTO CO., USA) 21 April 1993 (1993-04-21) page 69; claims 2,610; examples 120,121 -----</p>	1,2,4-7
A	<p>EP 0 545 099 A2 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 9 June 1993 (1993-06-09) cited in the application pages 8-11; claims 1,8,11; example 5 -----</p>	1-7
		-/-

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 03/080628 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG; EHRENFREUND, JOSEF; JUNG, PIERRE, JOSEPH,) 2 October 2003 (2003-10-02) cited in the application -----	1-7
Y	LUKEVICS E.: "Biolgical Activity of Nitrogen containing Organosilicon Compounds" NOBEL SYMP., no. 40, 1978, pages 435-445, XP002312113 page 436, line 8 - line 14 -----	1,2,4-7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/012590

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0538231	A	21-04-1993	AT 201958 T AU 664392 B2 AU 2809392 A CA 2119155 A1 CZ 9400887 A3 DE 69231872 D1 DE 69231872 T2 DK 538231 T3 EP 1088481 A2 EP 0538231 A1 ES 2159507 T3 GR 3036478 T3 HU 66952 A2 LT 193 A ,B LV 10020 A ,B MX 9206009 A1 NZ 244771 A PL 170837 B1 PT 538231 T SK 44894 A3 US 5998466 A US RE36562 E WO 9307751 A1 US 6248894 B1 US 6252078 B1 US 6166057 A US 6133252 A US 5498630 A US 5849723 A US 5693667 A US 5705513 A US 5834447 A US 6410558 B1 US 2001046975 A1 US 6028101 A ZA 9208024 A CN 1085221 A ,B CN 1225364 A CN 1225365 A HR 921338 B1 SI 9300030 A US 5811411 A	15-06-2001 16-11-1995 21-05-1993 29-04-1993 17-08-1994 19-07-2001 28-03-2002 27-08-2001 04-04-2001 21-04-1993 16-10-2001 30-11-2001 30-01-1995 25-10-1994 10-05-1994 01-11-1993 28-03-1995 31-01-1997 30-10-2001 12-04-1995 07-12-1999 08-02-2000 29-04-1993 19-06-2001 26-06-2001 26-12-2000 17-10-2000 12-03-1996 15-12-1998 02-12-1997 06-01-1998 10-11-1998 25-06-2002 29-11-2001 22-02-2000 27-08-1993 13-04-1994 11-08-1999 11-08-1999 30-04-2002 30-06-1994 22-09-1998
EP 0545099	A2	09-06-1993	AT 149487 T AU 656243 B2 AU 2855492 A CA 2081935 A1 CZ 9203448 A3 CZ 289478 B6 DE 59208113 D1 DK 545099 T3 ES 2098421 T3 GR 3023336 T3 HU 62861 A2 IL 103614 A JP 3202079 B2 JP 5221994 A JP 2001253802 A	15-03-1997 27-01-1995 27-05-1993 23-05-1993 13-10-1993 16-01-2002 10-04-1997 24-03-1997 01-05-1997 29-08-1997 28-06-1993 24-09-1998 27-08-2001 31-08-1993 18-09-2001

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/012590

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 0545099	A2	JP	2001316210 A	13-11-2001
		KR	267518 B1	16-10-2000
		NZ	245194 A	27-02-1996
		PL	296677 A1	18-10-1993
		SK	344892 A3	08-03-1995
		US	5480897 A	02-01-1996
		US	5556988 A	17-09-1996
		US	5589493 A	31-12-1996
		US	5330995 A	19-07-1994
		ZA	9208977 A	19-05-1994
WO 03080628	A1 02-10-2003	BR	0308759 A	28-12-2004
		CA	2477396 A1	02-10-2003
		EP	1490378 A1	29-12-2004

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/012590

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07F7/08

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBiete

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07F

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, X	<p>DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; COSTA, MIRCO ET AL: "Synthesis of 4H-3,1-Benzoxazines, Quinazolin-2-ones, and Quinolin-4-ones by Palladium-Catalyzed Oxidative Carbonylation of 2-Ethynylaniline Derivatives" XP002315416 gefunden im STN Database accession no. 2004:189014 Zusammenfassung & JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY , 69(7), 2469-2477 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 2004,</p> <p>-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	1, 2

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benützung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

27. Januar 2005

18/02/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Richter, H

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie ^a	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BARTOLI, GIUSEPPE ET AL: "A new approach to the synthesis of 2-substituted indoles: reaction of dimetallated ortho-trimethylsilylmethylanilides with esters" XP002315417 gefunden im STN Database accession no. 1990:423608 Zusammenfassung & TETRAHEDRON , 46(4), 1379-84 CODEN: TETRAB; ISSN: 0040-4020, 1990, -----	1,2
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SAKAMOTO, TAKAO ET AL: "Condensed heteroaromatic ring systems. XII. Synthesis of indole derivatives from ethyl 2-bromocarbanilates" XP002315418 gefunden im STN Database accession no. 1988:75166 Zusammenfassung & CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN , 35(5), 1823-8 CODEN: CPBTAL; ISSN: 0009-2363, 1987, -----	1,2
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HELLWINKEL, DIETER ET AL: "Carbanionically induced '1,3!-migrations of .pi.- and coordinatively unsaturated groups" XP002315419 gefunden im STN Database accession no. 1984:5549 Zusammenfassung & CHEMISCHE BERICHTE , 116(10), 3375-405 CODEN: CHBEAM; ISSN: 0009-2940, 1983, -----	1,2
Y	EP 0 538 231 A (MONSANTO CO., USA) 21. April 1993 (1993-04-21) Seite 69; Ansprüche 2,610; Beispiele 120,121 -----	1,2,4-7
A	EP 0 545 099 A2 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 9. Juni 1993 (1993-06-09) in der Anmeldung erwähnt Seiten 8-11; Ansprüche 1,8,11; Beispiel 5 -----	1-7
	-/--	

BEST AVAILABLE COPY

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 03/080628 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG; EHRENFREUND, JOSEF; JUNG, PIERRE, JOSEPH,) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) in der Anmeldung erwähnt -----	1-7
Y	LUKEVICS E.: "Biological Activity of Nitrogen containing Organosilicon Compounds" NOBEL SYMP., Nr. 40, 1978, Seiten 435-445, XP002312113 Seite 436, Zeile 8 - Zeile 14 -----	1,2,4-7

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/012590

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0538231	A	21-04-1993	AT	201958 T		15-06-2001
			AU	664392 B2		16-11-1995
			AU	2809392 A		21-05-1993
			CA	2119155 A1		29-04-1993
			CZ	9400887 A3		17-08-1994
			DE	69231872 D1		19-07-2001
			DE	69231872 T2		28-03-2002
			DK	538231 T3		27-08-2001
			EP	1088481 A2		04-04-2001
			EP	0538231 A1		21-04-1993
			ES	2159507 T3		16-10-2001
			GR	3036478 T3		30-11-2001
			HU	66952 A2		30-01-1995
			LT	193 A ,B		25-10-1994
			LV	10020 A ,B		10-05-1994
			MX	9206009 A1		01-11-1993
			NZ	244771 A		28-03-1995
			PL	170837 B1		31-01-1997
			PT	538231 T		30-10-2001
			SK	44894 A3		12-04-1995
			US	5998466 A		07-12-1999
			US	RE36562 E		08-02-2000
			WO	9307751 A1		29-04-1993
			US	6248894 B1		19-06-2001
			US	6252078 B1		26-06-2001
			US	6166057 A		26-12-2000
			US	6133252 A		17-10-2000
			US	5498630 A		12-03-1996
			US	5849723 A		15-12-1998
			US	5693667 A		02-12-1997
			US	5705513 A		06-01-1998
			US	5834447 A		10-11-1998
			US	6410558 B1		25-06-2002
			US	2001046975 A1		29-11-2001
			US	6028101 A		22-02-2000
			ZA	9208024 A		27-08-1993
			CN	1085221 A ,B		13-04-1994
			CN	1225364 A		11-08-1999
			CN	1225365 A		11-08-1999
			HR	921338 B1		30-04-2002
			SI	9300030 A		30-06-1994
			US	5811411 A		22-09-1998
EP 0545099	A2	09-06-1993	AT	149487 T		15-03-1997
			AU	656243 B2		27-01-1995
			AU	2855492 A		27-05-1993
			CA	2081935 A1		23-05-1993
			CZ	9203448 A3		13-10-1993
			CZ	289478 B6		16-01-2002
			DE	59208113 D1		10-04-1997
			DK	545099 T3		24-03-1997
			ES	2098421 T3		01-05-1997
			GR	3023336 T3		29-08-1997
			HU	62861 A2		28-06-1993
			IL	103614 A		24-09-1998
			JP	3202079 B2		27-08-2001
			JP	5221994 A		31-08-1993
			JP	2001253802 A		18-09-2001

INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/012590

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0545099	A2	JP 2001316210 A KR 267518 B1 NZ 245194 A PL 296677 A1 SK 344892 A3 US 5480897 A US 5556988 A US 5589493 A US 5330995 A ZA 9208977 A	13-11-2001 16-10-2000 27-02-1996 18-10-1993 08-03-1995 02-01-1996 17-09-1996 31-12-1996 19-07-1994 19-05-1994
WO 03080628	A1 02-10-2003	BR 0308759 A CA 2477396 A1 EP 1490378 A1	28-12-2004 02-10-2003 29-12-2004